Your Case: 4-32557 Our Ref: 912221

English translation of WO 2004/002963

CLAIMS:

5

10

15

 (\tilde{A})

1. An amide derivative which is represented by the following general formula [1]

$$\begin{array}{c|c} CH_3 & H \\ \hline & N \\ \hline & Het1 \\ \hline & Het2 \\ \hline & R^3 \\ \hline & CH_2 \\ \end{array}$$

wherein said compound meets the following condition either (A) or (B): Condition (A)

[1]

R¹ represents a saturated cyclic amino group (said saturated cyclic amino group being optionally substituted by one to three identical or different alkyl, alkoxycarbonyl, halogen, haloalkyl, hydroxyalkyl, amino, monoalkylamino, dialkylamino, carbamoyl, monoalkylamino or dialkylamino;

R² represents alkyl, halogen, haloalkyl, hydroxyalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkoxycarbonyl, acyl, amino, monoalkylamino, dialkylamino, nitro, carbamoyl, monoalkylcarbamoyl, dialkylcarbamoyl or cyano;

R³ represents hydrogen, halogen or alkoxy;

Het1 represents any one of the following groups of formulae [2] to [8]:

Your Case: 4-32557 Our Ref: 912221

English translation of WO 2004/002963

Het2 represents pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, pyridazinyl or 1,2-dihydropyridazinyl (said Het2 being optionally substituted by one to three identical or different alkyl, halogen or amino);

provided that compounds wherein R¹ is (i) pyrrolidinyl, piperidinyl, piperazinyl or morpholinyl which is optionally substituted by one to three identical or different alkyl, alkoxycarbonyl, halogen, haloalkyl, hydroxyalkyl, amino, monoalkylamino, dialkylamino, carbamoyl, monoalkylamoyl or dialkylcarbamoyl, or (ii) monoalkylamino, or (iii) dialkylamino, Het1 is a group of formula [6], Het2 is pyridyl which is optionally substituted by pyrazinyl or alkyl are excluded;

Condition (B)

5

10

15

R¹ represents 4-methylpiperazin-1-yl, 1-pyrrolidinyl, piperidino, 4-ethylpiperazin-1-yl, 4-n-propylpiperazin-1-yl, cis-3,5-dimethylpiperazin-1-yl, morpholino, dimethylamino or diethylamino;

R² represents methyl, halogen, trifluoromethyl, methoxy, methoxycarbonyl, nitro, dialkylcarbamoyl or cyano;

Hetl represents a group of formula [6];

Het2 represents 3-pyridyl

20 or a salt thereof.

2. An amide derivative according to claim 1 wherein

10

20

. :)

R¹ is a saturated cyclic amino group (said saturated cyclic amino group being optionally substituted by one to three identical or different alkyl or alkoxycarbonyl), monoalkylamino or dialkylamino;

R² is alkyl, halogen, haloalkyl, alkoxy, alkoxycarbonyl, nitro, dialkylcarbamoyl or cyano;

R³ is hydrogen, halogen or alkoxy;

Het1 is any one of the following groups of formulae [2] to [8];

Het2 is pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, pyridazinyl or 1,2-dihydropyridazinyl (said Het2 being optionally substituted by one to three identical or different halogen), or a salt thereof.

- 3. An amide derivative selected from the group consisting of the following compounds (1) to (40):
- 15 (1) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (2) 3-Iodo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (3) 3-Chloro-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (4) 3-Fluoro-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (5) 4-(4-Methylpiperazin-1-ylmethyl)-3-trifluoromethyl-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
- 25 (6) 4-(4-Methylpiperazin-1-ylmethyl)-3-trifluoromethyl-N-{4-methyl-3-[4-(5-pyrimidinyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (7) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(2-pyrazinyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
- (8) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{3-[4-(6-chloropyridin-3-yl)-pyrimidin-2-ylamino]-4-methylphenyl}-benzamide;

10

20

- (9) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{3-[4-(5-bromopyridin-3-yl)-pyrimidin-2-ylamino]-4-methylphenyl}-benzamide;
- (10) 4-(4-Methylpiperazin-1-ylmethyl)-3-trifluoromethyl-N-{3-[4-(5-bromopyridin-3-yl)-pyrimidin-2-ylamino]-4-methylphenyl}-benzamide;
- 5 (11) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{3-[4-(1,2-dihydropyridazin-4-yl)-pyrimidin-2-ylamino]-4-methylphenyl}-benzamide;
 - (12) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridazinyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (13) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(5-pyrimidinyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (14) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyridin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (15) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(5-pyrimidinyl)-pyridin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
- 15 (16) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[2-(3-pyridyl)-pyridin-6-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (17) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[3-(3-pyridyl)-pyridin-5-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (18) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[3-(3-pyridyl)-phenylaminol-phenyl}-benzamide;
 - (19) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[2-(3-pyridyl)-pyrazin-6-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (20) 3-Bromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[5-(3-pyridyl)-1,2,4-triazin-3-ylamino]-phenyl}-benzamide;
- 25 (21) 3-Methyl-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (22) 4-(4-Methylpiperazin-1-ylmethyl)-3-nitro-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (23) 3-Methoxy-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-
- 30 pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;

. ;;;)

10

20

30

(...)

- (24) 3,5-Dibromo-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
- (25) 3,5-Dimethoxy-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
- 5 (26) 3-(N,N-Dimethylcarbamoyl)-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (27) 3-Bromo-4-(4-ethylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (28) 3-Bromo-4-[4-(n-propyl)-piperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (29) 3-Bromo-4-(N,N-dimethylaminomethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (30) 3-Bromo-4-(N,N-diethylaminomethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
- 15 (31) 3-Bromo-4-(1-pyrrolidinylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (32) 3-Bromo-4-(piperidinomethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (33) 3-Bromo-4-(morpholinomethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (34) 3-Bromo-4-(cis-3,5-dimethylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (35) 3-Bromo-4-(4-methyl-hexahydro-1H-1,4-diazepin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
- 25 (36) 3-Bromo-4-(1-piperazinylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(5-pyrimidinyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (37) 4-[4-(t-Butoxycarbonyl)-piperazin-1-ylmethyl)-3-trifluoromethyl-N-{4-methyl-3-[4-(5-pyrimidinyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
 - (38) 4-[1-Piperazinylmethyl)-3-trifluoromethyl-N-{4-methyl-3-{4-(5-pyrimidinyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;

Your Case: 4-32557 Our Ref: 912221

English translation of WO 2004/002963

- (39) 3-Methoxycarbonyl-4-{4-methylpiperazin-1-ylmethyl-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide;
- (40) 3-Cyano-4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-N-{4-methyl-3-[4-(3-pyridyl)-pyrimidin-2-ylamino]-phenyl}-benzamide
- 5 and salts thereof.

20

- 4. A pharmaceutical composition which contains an amide derivative according to any one of claims 1 to 3 or a salt thereof as active ingredient.
- 5. A BCR-ABL tyrosine kinase inhibitory agent which contains an amide derivative according to any one of claims 1 to 3 or a salt thereof as active ingredient.
- 6. A therapeutic agent for chronic myelogenous leukemia which contains an amide derivative according to any one of claims 1 to 3 or a salt thereof as active ingredient.
 - 7. A therapeutic agent for acute lymphatic leukemia which contains an amide derivative according to any one of claims 1 to 3 or a salt thereof as active ingredient.
 - 8. A therapeutic agent for acute myelogenous leukemia which contains an amide derivative according to any one of claims 1 to 3 or a salt thereof as active ingredient.



(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2004 年1 月8 日 (08.01.2004)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 2004/002963 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 239/42, 401/04, A61K 31/505, 31/506, A61P 35/02, 43/00

A61K 31/505, 31/506, A61F 35/02, 45/00

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2003/008192

(22) 国際出願日:

()

 (\cdot,\cdot)

2003 年6 月27 日 (27.06.2003)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ: 特願2002-189269 2002 年6 月28 日 (28.06.2002) JP 特願 2002-305146

2002年10月18日(18.10.2002) J

特願 2002-377937

2002年12月26日(26.12.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本新 菜株式会社 (NIPPON SHINYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒601-8550 京都府 京都市 南区吉祥院西ノ庄門ロ町 1 4 番地 Kyoto (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 浅木 哲夫 (ASAKI,Tetsuo) [JP/JP]; 〒611-0041 京都府 宇治市 槇 島町月夜6-1 朝日プラザ宇治 7 2 1 Kyoto (JP). 浜 本 泰介 (HAMAMOTO,Taisuke) [JP/JP]; 〒580-0032 大阪府 松原市 天美東 2-1 5 6-2 5 Osaka (JP). 杉 山 幸輝 (SUGIYAMA,Yukiteru) [JP/JP]; 〒607-8182 京 都府 京都市 山科区大宅坂ノ辻町39番地 日本新築 山科社宅1-2 C Kyoto (JP).

- (74) 代理人: 淯水 尚人 (SHIMIZU,Naoto); 〒601-8550 京都府 京都市南区吉祥院西ノ庄門口町 1 4番地日本新菜株式会社 知的財産部 Kyoto (JP).
- (81) 指定国 (国内): AB, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EB, ES, FI, GB, GD, GB, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, YP, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開存類: 一 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: AMIDE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: アミド誘導体及び医薬

WO 2004/002963 A1

(57) Abstract: An amide derivative represented by the following general [6] (wherein R1 formula (1): represents saturated cyclic amino, etc.; R2 represents alkyl, halogeno, R³ represents haloalkyl, etc.; halogeno, etc.; Het2 hydrogen, represents pyridyl, pyrimidyl, etc.; and Het1 represents, e.g., a group represented by the formula [6] above) or a salt thereof; and a medicinal composition containing either of these as an active ingredient. The derivative and salt are useful as a BCR-ABL tyrosin kinase inhibitor.

[粮業有]

請求の範囲

1. 次の一般式 [1] で表される化合物であって、次の (A) 又は (B) の場合のいずれかであるアミド誘導体又はその塩。

(A)

5 R¹は、飽和環状アミノ基(かかる飽和環状アミノ基は、1~3個の同 ー又は異なる、アルキル、アルコキシカルボニル、ハロゲン、ハロアル キル、ヒドロキシアルキル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキル アミノ、カルバモイル、モノアルキルカルバモイル又はジアルキルカル バモイルで置換されていてもよい。)、モノアルキルアミノ又はジアルキ 10 ルアミノを表す。

R²は、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アシル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ニトロ、カルバモイル、モノアルキルカルバモイル、ジアルキルカルバモイル又はシアノを表す。

15 R³は、水素、ハロゲン又はアルコキシを表す。

Het1は、次の式[2]~[8]のいずれかの基を表す。

Het2は、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル又は1,2-ジヒドロピリダジニルを表す(かかるHet2は、1~3個の同一又は異なる、アルキル、ハロゲン又はアミノで置換されていてもよい。)。

但し、R¹が、(i) 1~3個の同一又は異なる、アルキル、アルコキシカルボニル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、カルバモイル、モノアルキルカルバモイル又はジアルキルカルバモイルで置換されていてもよい、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル若しくはモルホリニル、(ii) モノアルキルアミノ、又は、(iii) ジアルキルアミノであり、Het 1が、式[6]の基であり、Het 2が、ピラジニル又はアルキルで置換されていてもよいピリジルである化合物、を除く。

(B)

R¹は、4-メチルピペラジン-1-イル、1-ピロリジニル、ピペリ ジノ、4-エチルピペラジン-1-イル、4-n-プロピルピペラジン-1-イル、シス-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル、モルホリノ、 ジメチルアミノ又はジエチルアミノを表す。

R²は、メチル、ハロゲン、トリフルオロメチル、メトキシ、メトキシ カルボニル、ニトロ、ジメチルカルバモイル又はシアノを表す。

20 R³は、水素、ブロモ又はメトキシを表す。

. Hetlは、式[6]の基を表す。

Het2は、3-ピリジルを表す。

- 2. 一般式 [1] において、R'が、飽和環状アミノ基(かかる飽和環状アミノ基は、1~3個の同一又は異なる、アルキル又はアルコキシカルボニルで置換されていてもよい。)、モノアルキルアミノ又はジアルキルアミノであり、
- R^2 が、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、アルコキシ、アルコキシ カルボニル、ニトロ、ジアルキルカルバモイル又はシアノであり、

R³が、水素、ハロゲン又はアルコキシであり

Het1が、式[2]~[8]のいずれかの基であり、

Het2が、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル又 10 は1,2-ジヒドロピリダジニルである(かかるHet2は、1~3個 の同一又は異なる、ハロゲンで置換されていてもよい。)、請求項1記載 のアミド誘導体又はその塩。

3. アミド誘導体が、次の(1)~(40)の化合物からなる群から選択される化合物である、請求項1記載のアミド誘導体又はその塩。

- 15 (1) 3-プロモー4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル)ー N-{4-メチル-3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド
 - (2) $3-3-ド-4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル) N-<math>\{4-メチル-3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル} ペンズアミド$
 - (3) $3-クロロ-4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル)-N-{4-メチル-3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド$
- (4) 3-フルオロー4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル)25 -N-{4-メチル-3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド
 - (5) 4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル) <math>-3-トリフル オロメチル $-N-(4-メチル-3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド$

PCT/JP2003/008192

WO 2004/002963

- (6) 4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル) -3-トリフル オロメチル-N- {4-メチル-3-[4-(5-ピリミジニル) ピリ ミジン-2-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド
- (7) 3-プロモー4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル)-
- 5 N- {4-メチル-3- [4-(2-ピラジニル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド
 - (8) 3-プロモー4- (4-メチルピペラジン-1-イルメチル) N- {3- [4-(6-クロロピリジン-3-イル) ピリミジン-2-イルアミノ] -4-メチルフェニル} ベンズアミド
- 10 (9) 3 プロモー4 (4 メチルピペラジン-1 イルメチル) N {3 [4 (5 プロモピリジン-3 イル) ピリミジン-2 イルアミノ] 4 メチルフェニル} ベンズアミド
 - (10) 4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル) -3-トリフルオロメチル-N-{3-[4-(5-ブロモピリジン-3-イル) ピリミジン-2-イルアミノ] -4-メチルフェニル} ベンズアミド
- (11) 3-プロモー4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル)
 -N-(3-[4-(1, 2-ジヒドロピリダジン-4-イル) ピリミジン-2-イルアミノ] -4-メチルフェニル} ベンズアミド
 - (12) 3-プロモー4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル)
- 20 -N- {4-メチル-3- [4-(3-ピリダジニル) ピリミジン-2 -イルアミノ] フェニル} ベンズアミド
 - (13) 3-プロモー4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル) -N- {4-メチル-3-[4-(5-ピリミジニル) ピリミジン-2 -イルアミノ] フェニル} ベンズアミド
- - (15) $3-プロモー4-(4-メチルピペラジンー1-イルメチル) <math>-N-\{4-メチル-3-[4-(5-ピリミジニル) ピリジンー2-95$



イルアミノ] フェニルトペンズアミド

- (16) 3-プロモー4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル) -N- {4-メチル-3-[2-(3-ピリジル) ピリジン-6-イル アミノ] フェニル} ベンズアミド
- 5 (17) 3-プロモー4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル) -N-{4-メチル-3-[3-(3-ピリジル) ピリジン-5-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド
 - (18) 3ープロモー4ー (4ーメチルピペラジンー1ーイルメチル) -Nー (4ーメチルー3ー [3ー (3ーピリジル) フェニルアミノ] フ
- 10 ェニル〉ベンズアミド

 (19)3-プロモー4ー(4-メチルピペラジン-1-イルメチル)
 -N-{4-メチル-3-[2-(3-ピリジル)ピラジン-6-イルアミノ]フェニル〉ベンズアミド
 - (20) 3-プロモー4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル)
- 15 -N- {4-メチル-3- [5- (3-ピリジル) -1, 2, 4-トリアジン-3-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド (21) 3-メチル-4- (4-メチルピペラジン-1-イルメチル) -N- {4-メチル-3- [4- (3-ピリジル) ピリミジン-2-イ

ルアミノ] フェニル} ベンズアミド

- 20 (22) 4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル) -3-ニトロ -N-{4-メチル-3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イ ルアミノ] フェニル} ベンズアミド
 - (23) 3-メトキシー <math>4-(4-メチルピペラジンー1-イルメチル) $-N-\{4-メチルー3-[4-(3-ピリジル) ピリミジンー2-イルアミノ] フェニル} ペンズアミド$
- (24) 3, 5ージプロモー4ー(4ーメチルピペラジンー1ーイルメチル) -N- {4ーメチルー3ー [4ー(3ーピリジル) ピリミジンー2ーイルアミノ] フェニル} ベンズアミド
 - (25) 3, 5-ジメトキシ-4- (4-メチルピペラジン-1-イル



25

フェニルトベンズアミド

ニル} ベンズアミド

20

メチル) - N - {4-メチル-3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド

(26) 3 - $(N, N-ジメチルカルバモイル) <math>-4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル) <math>-N-\{4-メチル-3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル} ペンズアミド$

- (27) 3-プロモー4-(4-エチルピペラジン-1-イルメチル)
 -N-{4-メチル-3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド
- (28) 3-プロモー4-[4-(n-プロピル) ピペラジンー1ーイ <math>10 ルメチル] $-N-\{4-メチル-3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル パンズアミド <math>(29)$ $3-プロモー4-(N,N-ジメチルアミノメチル) <math>-N-\{4-メチル-3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ]$
- 15 (30) 3-プロモー4-(N, N-ジエチルアミノメチル)-N-{4-メチル-3-[4-(3-ピリジル)ピリミジン-2-イルアミノ]フェニル}ベンズアミド

 - (32) 3-プロモー4-(ピペリジノメチル)-N-{4-メチルー3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド
- (33) 3-プロモー4ー(モルホリノメチル)ーNー(4ーメチルー3-[4-(3-ピリジル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル)ベンズアミド
 - (34) 3 プロモー4 (シスー3, 5 ジメチルピペラジンー1 イルメチル) N $\{4$ メチルー3 [4 (3 ピリジル) ピリミジン-2 イルアミノ] フェニル} ペンズアミド

K

- (36) 3-プロモー4-(1-ピペラジニルメチル) -N- {4-メ5 チル-3-[4-(5-ピリミジニル) ピリミジン-2-イルアミノ]フェニル} ベンズアミド
 - (37) 4- [4-(t-プトキシカルボニル) ピペラジン-1-イルメチル]-3-トリフルオロメチル-N-(4-メチル-3-[4-(5-ピリミジニル) ピリミジン-2-イルアミノ] フェニル) ベンズアミ
 - (38) $4-(1-ピペラジニルメチル) -3-トリフルオロメチルー <math>N-(4-メチル-3-[4-(5-ピリミジニル) ピリミジン-2- イルアミノ] フェニル} ベンズアミド$
- (39) 3-メトキシカルボニルー4-(4-メチルピペラジンー1-15 イルメチル)-N-{4-メチルー3-[4-(3-ピリジル) ピリミジンー2-イルアミノ] フェニル} ベンズアミド
 - (40) 3-シアノ-4- (4-メチルピペラジン-1-イルメチル) -N- {4-メチル-3- [4-(3-ピリジル) ピリミジン-2ーイ ルアミノ] フェニル} ベンズアミド
- 20 4. 請求項1~3のいずれかに記載のアミド誘導体又はその塩を有効成 分とする医薬組成物。
 - 5. 請求項1~3のいずれかに記載のアミド誘導体又はその塩を有効成分とするBCR-ABLチロシンキナーゼ阻害剤。
- 6. 請求項1~3のいずれかに記載のアミド誘導体又はその塩を有効成 25 分とする慢性骨髄性白血病治療剤。
 - 7. 請求項1~3のいずれかに記載のアミド誘導体又はその塩を有効成分とする急性リンパ性白血病治療剤。
 - 8. 請求項1~3のいずれかに記載のアミド誘導体又はその塩を有効成分とする急性骨髄性白血病治療剤。